

16.11.00
PCT/JP00/06514

日本国特許庁

PATENT OFFICE
JAPANESE GOVERNMENT

EKU

JP00/6514\$2

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日
Date of Application:

1999年 9月24日

REC'D 22 DEC 2000

出願番号
Application Number:

平成11年特許願第270582号

WIPO PCT

出願人
Applicant(s):

日本農薬株式会社

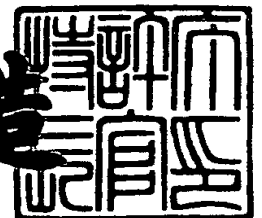
PRIORITY
DOCUMENT

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

2000年11月 6日

特許庁長官
Commissioner,
Patent Office

及川耕造



出証番号 出証特2000-3090375

【書類名】 特許願
 【整理番号】 C7729
 【提出日】 平成11年 9月24日
 【あて先】 特許庁長官 殿
 【国際特許分類】 C07C233/64
 A01N 37/18

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府堺市北野田 2 9 6 - 1

【氏名】 遠西 正範

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府河内長野市原町 2 7 0

【氏名】 中尾 勇美

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府羽曳野市誉田 7 丁目 7 5 6 番地の 2 - 3 0 2

【氏名】 河野 栄司

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府富田林市甲田 3 丁目 7 - 2 2 - 2 0 2

【氏名】 西田 立樹

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府泉佐野市日根野 2 8 2 1

【氏名】 古谷 敬

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府河内長野市木戸町 9 7 4 - 9 0 - 3 0 3

【氏名】 清水 寿明

【発明者】

【住所又は居所】 和歌山県橋本市紀見ヶ丘 2 丁目 3 番 1 9 号

【氏名】 瀬尾 明

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府河内長野市本多町 5 - 6 - 3 0 1

【氏名】 坂田 和之

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府河内長野市上原町 4 7 4 - 1 - 1 0 3

【氏名】 藤岡 伸祐

【発明者】

【住所又は居所】 大阪府茨木市白川 3 - 2、 2 - 7 0 8

【氏名】 菅野 英夫

【特許出願人】

【識別番号】 000232623

【氏名又は名称】 日本農業株式会社

【代理人】

【識別番号】 100068618

【弁理士】

【氏名又は名称】 萆 経夫

【電話番号】 03-3291-9721

【選任した代理人】

【識別番号】 100093193

【弁理士】

【氏名又は名称】 中村 壽夫

【選任した代理人】

【識別番号】 100104145

【弁理士】

【氏名又は名称】 宮崎 嘉夫

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 018120

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【プルーフの要否】 要

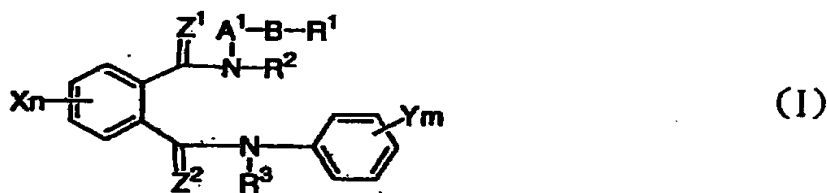
【書類名】 明細書

【発明の名称】 フタル酸ジアミド誘導体又はその塩類及び農園芸用薬剤並びにその使用方法

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 一般式 (I)

【化 1】



{式中、 A^1 は (C_1-C_8) アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基又はフェニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換 (C_1-C_8) アルキレン基、 (C_3-C_8) アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基又はフェニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換 (C_3-C_8) アルケニレン基、 (C_3-C_8) アルキニレン基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハ

ロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基又はフェニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換 (C_3-C_8) アルキニレン基を示す。

又、前記 (C_1-C_8) アルキレン基、置換 (C_1-C_8) アルキレン基、 (C_3-C_8) アルケニレン基、置換 (C_3-C_8) アルケニレン基、 (C_3-C_8) アルキニレン基又は置換 (C_3-C_8) アルキニレン基中の任意の飽和炭素原子は (C_2-C_5) アルキレン基で置換されて (C_3-C_6) シクロアルカン環を示すこともでき、前記 (C_1-C_8) アルキレン基、置換 (C_1-C_8) アルキレン基、 (C_3-C_8) アルケニレン基、置換 (C_3-C_8) アルケニレン基中の任意の 2 個の炭素原子はアルキレン基又はアルケニレン基と一緒にあって (C_3-C_6) シクロアルカン環又は (C_3-C_6) シクロアルケン環を示すこともできる。

B は $-CO-$ 又は $-C(=N-OR^4)-$ (式中、 R^4 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_3-C_6) アルケニル基、ハロ (C_3-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、フェニル (C_1-C_4) アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_4) アルキル基を示す。) を示す。

R^1 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、ハロ (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキル

スルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスル
 ホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基
 、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシ
 カルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル
 アミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1
 $-C_6$)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C
 $-C_6$)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1
 $-C_6$)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)
 アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アル
 キルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C
 $-C_6$)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フ
 ェニルアミノ基、フェニルオキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、
 シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)
 アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1
 $-C_6$)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル
 スルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホ
 ニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)ア
 ルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置
 換基を環上に有する置換フェニルオキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっ
 ても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C
 $-C_6$)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)ア
 ルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基
 、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ
 (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異な
 っても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基か
 ら選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルチオ基、複素環基又は
 同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)ア
 ルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アル
 コキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)ア

ルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。又、 R^1 は A^1 と結合して、1~2 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い 5~8 員環を形成することができる。

R^2 及び R^3 は同一又は異なっても良く、水素原子、(C_3-C_6)シクロアルキル基又は $-A^2-R^5$ (式中、 A^2 は $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-C(=NR^6)-$ (式中、 R^6 は水素原子、(C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、(C_1-C_6)アルコキシカルボニル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。) 、(C_1-C_8)アルキレン基、ハロ (C_1-C_8)アルキレン基、(C_3-C_6)アルケニレン基、ハロ (C_3-C_6)アルケニレン基、(C_3-C_6)アルキニレン基又はハロ (C_3-C_6)アルキニレン基を示し、

(1) A^2 が $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 又は $-C(=NR^6)-$ (式中、 R^6 は前記に同じ。) を示す場合、 R^5 は水素原子、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6)シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アル

キルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^3-R^7$ (式中、 A^3 は $-O-$ 、 $-S-$ 又は $-N(R^8)-$ (式中、 R^8 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、フェニル (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基を示す。) を示し、 R^7 は (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (

C_1-C_6)アルキル基、 (C_3-C_6) アルケニル基、ハロ (C_3-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) アルキニル基、ハロ (C_3-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル (C_1-C_4) アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル (C_1-C_4) アルキル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。)を示す。

(2) A^2 が (C_1-C_8) アルキレン基、ハロ (C_1-C_8) アルキレン基、 (C_3-C_6) アルケニレン基、ハロ (C_3-C_6) アルケニレン基、 (C_3-C_6) アルキニレン基又はハロ (C_3-C_6) アルキニレン基を示す場合、 R^5 は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、

ニトロ基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^4-R^9$ (式中、 A^4 は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-N(R^8)-$ (式中、 R^8 は前記に同じ。)、 $-C(=O)-$ 又は $-C(=NOR^4)-$ (式中、 R^4 は前記に同じ。)) を示し、
(i) A^4 が $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 又は $-N(R^8)-$ (式中、 R^8 は前記に同じ。) を示す場合、 R^9 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_3-C_6) アルケニル基、ハロ (C_3-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) アルキニル基、ハロ (C_3-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又

は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル (C_1-C_4)アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_4)アルキル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

(ii) A^4 が $-C(=O)-$ 又は $-C(=N-OR^4)-$ (式中、 R^4 は前記に同じ。)を示す場合、 R^9 は水素原子、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_2-C_6)アルケニル基、ハロ (C_2-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6)シクロアルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (

C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、

モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、フェニルオキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルオキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (

C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。)を示す。)を示す。

又、 R^2 は A^1 又は R^1 と結合して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5~7員環を形成することができる。

Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^5-R^{10}$ (式中、 A^5 は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=NOR^4)-$ (式中、 R^4 は前記に同じ。))、 (C_1-C_6) アルキレン基、ハロ (C_1-C_6) アルキレン基、 (C_2-C_6) アルケニレン基、ハロ (C_2-C_6) アルケニレン基、 (C_2-C_6) アルキニレン基又はハロ (C_3-C_6) アルキニレン基を示し、

(1) A^5 が $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 又は $-SO_2-$ を示す場合、 R^{10} はハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルケニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル

基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基

、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^6-R^{11}$ (式中、 A^6 は (C_1-C_6)アルキレン基、ハロ (C_1-C_6)アルキレン基、(C_3-C_6)アルケニレン基、ハロ (C_3-C_6)アルケニレン基、(C_3-C_6)アルキニレン基又はハロ (C_3-C_6)アルキニレン基を示し、 R^{11} は水素原子、ハロゲン原子、(C_3-C_6)シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6)シクロアルキル基、(C_1-C_6)アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基又は $-A^7-R^{12}$ (式中、 A^7 は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 又は $-SO_2-$ を示し、 R^{12} は (C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_3-C_6)アルケニル基、ハロ (C_3-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)アルキニル基、ハロ (C_3-C_6)アルキニル基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6)シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、

(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。)を示し、

(2) A^5 が $-C(=O)-$ 又は $-C(=NOR^4)-$ (式中、 R^4 は前記に同じ。)を示す場合、 R^{10} は (C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_2-C_6)アルケニル基、ハロ (C_2-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6)シクロアルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1

(C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示し、

(3) A^5 が (C_1-C_6) アルキレン基、ハロ (C_1-C_6) アルキレン基、 (C_2-C_6) アルケニレン基、ハロ (C_2-C_6) アルケニレン基、 (C_2-C_6) アルキニレン基又はハロ (C_3-C_6) アルキニレン基を示す場合、 R^{10} は水素原子、ハロゲン原子、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ

基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^8-R^{13}$ (式中、 A^8 は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 又は $-SO_2-$ を示し、 R^{13} は (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^9-R^{14}$ (式中、 A^9 は (C_1-C_6) アルキレン基、ハロ (C_1-C_6) アルキレン基、 (C_2-C_6) アルケニレン基、ハロ (C_2-C_6) アルケニレン基、 (C_2-C_6) アルキニレン基又はハロ (C_3-C_5) アルキニレン基を示し、 R^{14} は水素原子、ハロゲン原子、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モ

ノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する複素環基を示す。)を示す。)を示す。

又、フェニル環上の隣接した 2 個の X は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(

C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有することもでき、 n は 0~4 の整数を示す。

Y は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_3-C_6)シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^5-R^{10}$ (式中、 A^5 及び R^{10} は前記に同じ。)を示す。

又、フェニル環上の隣接した 2 個の Y は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アル

キルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基から選択される 1 以上の置換基を有することもでき、 m は 0 ~ 5 の整数を示す。

Z^1 及び Z^2 は酸素原子又は硫黄原子を示す。}

で表されるフタル酸ジアミド誘導体又はその塩類。

【請求項 2】 請求項 1 記載のフタル酸ジアミド誘導体又はその塩類を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用薬剤。

【請求項 3】 農園芸用薬剤が殺虫剤である請求項 2 記載の農園芸用薬剤。

【請求項 4】 有用植物から害虫を防除するため請求項 2 又は 3 記載の農園芸用薬剤の有効量を対象作物植物体又は土壌に処理することを特徴とする農園芸用薬剤の使用方法。

【請求項 5】 農園芸用薬剤が殺虫剤である請求項 4 記載の使用方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明はフタル酸ジアミド誘導体又はその塩類及び該化合物又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

【0002】

【従来技術】

EPC公開第919542A2号公報に本発明のフタル酸ジアミド誘導体に類似した化合物が開示されている。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】

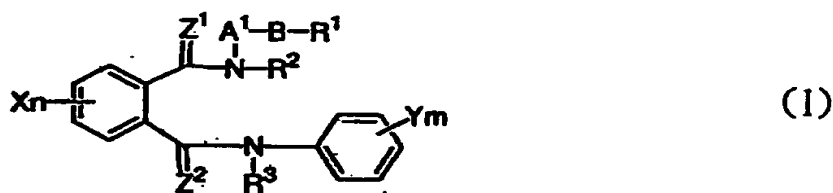
本発明者等は新規な農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤を開発すべく鋭意研究を重ねた結果、本発明の一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体又はその塩類は文献未記載の新規化合物であり、農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤として有用な化合物であることを見だし、本発明を完成させたものである。

【0004】

【課題を解決するための手段】

本発明は、一般式(I)：

【化2】



{式中、 A^1 は (C_1-C_8) アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、 (C_1-C_6) アルキルチオ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基又はフェニル基から選択される1以上の置換基を有する置換 (C_1-C_8) アルキレン基、

【0005】

(C_3-C_8) アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) ア

ルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、(C_1-C_6)アルキルチオ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシカルボニル基又はフェニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換 (C_3-C_8)アルケニレン基、(C_3-C_8)アルキニレン基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、(C_1-C_6)アルキルチオ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシカルボニル基又はフェニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換 (C_3-C_8)アルキニレン基を示す。

【0006】

又、前記 (C_1-C_8)アルキレン基、置換 (C_1-C_8)アルキレン基、(C_3-C_8)アルケニレン基、置換 (C_3-C_8)アルケニレン基、(C_3-C_8)アルキニレン基又は置換 (C_3-C_8)アルキニレン基中の任意の飽和炭素原子は (C_2-C_5)アルキレン基で置換されて (C_3-C_6)シクロアルカン環を示すこともでき、前記 (C_1-C_8)アルキレン基、置換 (C_1-C_8)アルキレン基、(C_3-C_8)アルケニレン基、置換 (C_3-C_8)アルケニレン基中の任意の 2 個の炭素原子はアルキレン基又はアルケニレン基と一緒にあって (C_3-C_6)シクロアルカン環又は (C_3-C_6)シクロアルケン環を示すこともできる。

B は $-CO-$ 又は $-C(=N-OR^4)-$ (式中、 R^4 は水素原子、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_3-C_6)アルケニル基、ハロ (C_3-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)アルキニル基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、

【0007】

フェニル (C_1-C_4)アルキル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (

C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_4) アルキル基を示す。)を示す。

【0008】

R^1 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_2-C_6) アルケニル基、ハロ (C_2-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、

【0009】

フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、フェニルオキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキ

ルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルオキシ基、

【0010】

フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、 (C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、 (C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、 (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、

【0011】

ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、 (C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、 (C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、 (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。又、 R^1 は A^1 と結合して、1～2 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い 5～8 員環を形成することができる。

【0012】

R^2 及び R^3 は同一又は異なっても良く、水素原子、 (C_3-C_6)シクロアルキル基又は $-A^2-R^5$ (式中、 A^2 は $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-C(=NR^6)-$ (式中、 R^6 は水素原子、 (C_1-C_6)アルキル基、 (C_1-C_6)アルコキシ基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、 (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6)アルキル基、ハロ (

C_1-C_6)アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。)、 (C_1-C_8) アルキレン基、ハロ (C_1-C_8) アルキレン基、 (C_3-C_6) アルケニレン基、ハロ (C_3-C_6) アルケニレン基、 (C_3-C_6) アルキニレン基又はハロ (C_3-C_6) アルキニレン基を示し、

【0013】

(1) A^2 が $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 又は $-C(=NR^6)-$ (式中、 R^6 は前記に同じ。)を示す場合、 R^5 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、

【0014】

ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^3-R^7$ (式中、 A^3 は $-O-$

、 $-S-$ 又は $-N(R^8)-$ （式中、 R^8 は水素原子、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニルカルボニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、

【0015】

ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルカルボニル基、フェニル (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、

【0016】

モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_4) アルコキシカルボニル基を示す。)を示し、 R^7 は (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_3-C_6) アルケニル基、ハロ (C_3-C_6) アルケニル基、 (C_3-C_6) アルキニル基、ハロ (C_3-C_6) アルキニル基、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルカルボニル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、

【0017】

モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニル (C_1-C_4)アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル (C_1-C_4)アルキル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

)を示す。

【0018】

(2) A^2 が (C_1-C_8)アルキレン基、ハロ (C_1-C_8)アルキレン基、(C_3-C_6)アルケニレン基、ハロ (C_3-C_6)アルケニレン基、(C_3-C_6)アルキニレン基又はハロ (C_3-C_6)アルキニレン基を示す場合、 R^5 は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6)シクロアルキル基、(C_1-C_6)アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルス

ルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、

【0019】

ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^4-R^9$ (式中、 A^4 は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-N(R^8)-$ (式中、 R^8 は前記に同じ。)、 $-C(=O)-$ 又は $-C(=NOR^4)-$ (式中、 R^4 は前記に同じ。)) を示し、

【0020】

(i) A^4 が $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 又は $-N(R^8)-$ (式中、 R^8 は前記に同じ。) を示す場合、 R^9 は水素原子、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_3-C_6)アルケニル基、ハロ (C_3-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)アルキニル基、ハロ (C_3-C_6)アルキニル基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6)シクロアルキル基、(C_1-C_6)アルキルカルボニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルカルボニル基、(C_1-C_6)アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、

【0021】

フェニル (C_1-C_4)アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニル (C_1-C_4)アルキル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

【0022】

(ii) A^4 が $-C(=O)-$ 又は $-C(=N-OR^4)-$ (式中、 R^4 は前記に同じ。)を示す場合、 R^9 は水素原子、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_2-C_6)アルケニル基、ハロ (C_2-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6)シクロアルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェ

ニル基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、

【0023】

シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、フェニルオキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルオキシ基、

【0024】

フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、

ホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。)を示す。)を示す。

【0025】

又、 R^2 は A^1 又は R^1 と結合して、1～2 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い 5～7 員環を形成することができる。

X は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6)シクロアルキル基、(C_1-C_6)アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、

【0026】

(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^5-R^{10}$ (式中、 A^5 は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=NOR^4)-$ (式中、 R^4 は前記に同じ。))、(C_1-C_6)アルキレン基、ハロ (C_1-C_6)アルキレン基、(C_2-C_6)アルケニレン基、ハロ (C_2-C_6)アルケニレン基、(C_2-C_6)アルキニレン基又はハロ (C_3-C_6)アルキニレン基を示し、

【0027】

(1) A^5 が $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 又は $-SO_2-$ を示す場合、 R^{10} はハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルケニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、~~(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキル~~スルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、

【0028】

(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^6-R^{11}$ (式中、 A^6 は (C_1-C_6) アルキレン基、ハロ (C_1-C_6) アルキレン基、(C_3-C_6) アルケニレン基、ハロ (C_3-C_6) アルケニレン基、(C_3-C_6) アルキニレン基又はハロ (C_3-C_6) アルキニレン基を示し、 R^{11} は水素原子、ハロゲン原子、(C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、(C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6) アルキルスルホニル基、

【0029】

ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は

異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基又は $-A^7-R^{12}$ (式中、 A^7 は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ 又は $-SO_2-$ を示し、 R^{12} は (C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_3-C_6)アルケニル基、ハロ (C_3-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)アルキニル基、ハロ (C_3-C_6)アルキニル基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6)シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、

【0030】

同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示す。)を示し、

【0031】

(2) A^5 が $-C(=O)-$ 又は $-C(=NOR^4)-$ (式中、 R^4 は前記に同じ。)を示す場合、 R^{10} は (C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_2-C_6)アルケニル基、ハロ (C_2-C_6)アルケニル基、(C_3-C_6)シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6)シクロアルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニ

トロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、

【0032】

(C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基を示し、

【0033】

(3) A^5 が (C_1-C_6) アルキレン基、ハロ (C_1-C_6) アルキレン基、 (C_2-C_6) アルケニレン基、ハロ (C_2-C_6) アルケニレン基、 (C_2-C_6) アルキニレン基又はハロ (C_3-C_6) アルキニレン基を示す場合、 R^{10} は水素原子、ハロゲン原子、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハ

ロ (C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、

【0034】

ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は -A⁸-R¹³ (式中、A⁸ は -O-、-S-、-SO- 又は -SO₂- を示し、R¹³ は (C₃-C₆)シクロアルキル基、ハロ (C₃-C₆)シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、

【0035】

モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキルアミノ基又は (C₁-C₆)アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C₁-C₆)アルキル基、(C₁-C₆)アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆)アルコキシ基、(C₁-C₆)アルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆)アルキルチオ基、(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、ハロ (C₁-C₆)アルキルスルホニル基、モノ (C₁-C₆)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C₁-C₆)アルキル

ルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^9-R^{14}$ (式中、 A^9 は (C_1-C_6) アルキレン基、ハロ (C_1-C_6) アルキレン基、 (C_2-C_6) アルケニレン基、ハロ (C_2-C_6) アルケニレン基、 (C_2-C_6) アルキニレン基又はハロ (C_3-C_5) アルキニレン基を示し、

【0036】

R^{14} は水素原子、ハロゲン原子、 (C_3-C_6) シクロアルキル基、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、

【0037】

ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アル

キルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、

【0038】

モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する複素環基を示す。)を示す。)を示す。

【0039】

又、フェニル環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもでき、nは0~4の整数を示す。

【0040】

Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、ハロ (C_3-C_6)シクロアルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、(C_1-C_6)アルキル基、ハロ (C_1-C_6)アルキル基、(C_1-C_6)アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6)アルコキシ基、(C_1-C_6)アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6)アルキルチオ基、(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、

ニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換複素環基又は $-A^5-R^{10}$ (式中、 A^5 及び R^{10} は前記に同じ。)を示す。

【0041】

又、フェニル環上の隣接した 2 個の Y は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6) アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6) アルキルアミノ基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、

【0042】

(C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、

(C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1-C_6)アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6)アルキルスルホニル基、モノ (C_1-C_6)アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ (C_1-C_6)アルキルアミノ基又は (C_1-C_6)アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基から選択される1以上の置換基を有することもでき、 m は0～5の整数を示す。

Z^1 及び Z^2 は酸素原子又は硫黄原子を示す。}

で表されるフタル酸ジアミド誘導体又はその塩類及び農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

【0043】

【発明の実施の形態】

本発明の一般式(I) で表されるフタル酸ジアミド誘導体又はその塩類の一般式(I) の定義において「ハロゲン原子」とは塩素原子、臭素原子、沃素原子又はフッ素原子を示し、「(C_1-C_6)アルキル基」とは、例えばメチル、エチル、 n -プロピル、 i -プロピル、 n -ブチル、 i -ブチル、 s -ブチル、 t -ブチル、 n -ペンチル、 n -ヘキシル等の直鎖又は分枝状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示し、「ハロ (C_1-C_6)アルキル基」とは、同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は分枝状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示し、「(C_1-C_8)アルキレン基」はメチレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、ジメチルメチレン、テトラメチレン、イソブチレン、ジメチルエチレン、オクタメチレン等の直鎖又は分枝状の炭素原子数1～8個のアルキレン基を示す。

「(C_3-C_6)シクロアルキル基」とは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等の炭素原子3～6個の脂環式のアルキル基を示す。

【0044】

又、「 R^1 及び R^2 はお互いに結合して1～3個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い4～7員環」としては、例えばアゼチジン環、ピロリジン環、ピロリン環、ピペリジン環、イミダゾリジン環、イミダゾリン環、オキサゾリジン環、チアゾリジン環、イソキサゾリジン

環、イソチアゾリジン環、テトラヒドロピリジン環、ピペラジン環、モルホリン環、チオモルホリン環、ジオキサジン環、ジチアジン環等を例示することができる。

【0045】

「複素環基」としては、例えばピリジル基、ピリジン-N-オキシド基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフリル基、チエニル基、テトラヒドロチエニル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロチオピラニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピラゾリル基等を例示することができ、「縮合環」としては、例えばナフタレン、テトラヒドロナフタレン、インデン、インダン、キノリン、キナゾリン、インドール、インドリン、クロマン、イソクロマン、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ジヒドロベンゾフラン、ベンゾチオフエン、ジヒドロベンゾチオフエン、ベンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、ベンズイミダゾール、インダゾール等を例示することができる。

「塩類」としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩等の無機酸塩類、酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸塩等の有機酸塩類、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン等の金属イオン等との塩類を例示することができる。

【0046】

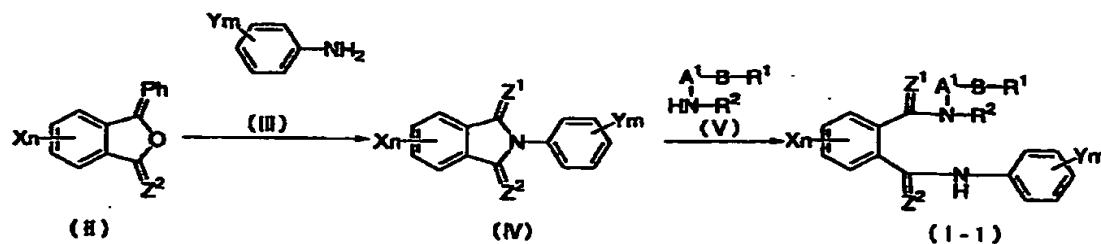
本発明の一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体又はその塩類は、その構造式中に1つ又は複数個の不斉炭素原子又は不斉中心を含む場合があり、2種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体又はその塩類は、その構造式中に炭素-炭素二重結合又は炭素-窒素二重結合に由来する2種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

本発明の一般式(I) で表されるフタル酸ジアミド誘導体又はその塩類は、例えば下記に図示する製造方法により製造することができるが、本発明は特願平10-350768号に開示の方法等でも製造でき、これらに限定されるものではない。

【0047】

製造方法1.

【化3】



(式中、 R^1 、 R^2 、 A^1 、 B 、 X 、 Y 、 m 、 n 、 Z^1 及び Z^2 は前記に同じ。)

一般式 (II) で表される無水フタル酸誘導体と一般式 (III) で表されるアニリン類とを不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式 (IV) で表されるフタル酸イミド誘導体とし、該フタル酸イミド誘導体 (IV) を単離し又は単離せずして一般式 (V) で表されアミン類と反応させることにより、一般式 (I-1) で表されるフタル酸ジアミド誘導体を製造することができる。

【0048】

(1) . 一般式 (II) → 一般式 (IV)

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の塩素化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、酢酸等の酸類、ジメチルスルホキシド、1, 3-ジメチル-2-イミダゾリジノン等の

不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

【0049】

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれかの反応剤を過剰に使用することもできる。本反応は必要に応じて脱水条件下で反応を行うこともできる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適宜選択すれば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。又、反応系から目的物を単離せずに次の反応工程に供することも可能である。

【0050】

一般式(II)で表される無水フタル酸誘導体は J. Org. Chem., 52, 129 (1987)、J. Am. Chem. Soc., 51, 1865 (1929)、同、63, 1542 (1941) 等に記載の方法により製造することができる。一般式(III)で表されるアニリン類は J. Org. Chem., 29, 1 (1964)、Angew. Chem. Int. Ed. Engl., 24, 871 (1985)、Synthesis, 1984, 667、日本化学会誌, 1973, 2351、DE-2606982号公報、特開平1-90163号公報等に記載の方法により製造することができる。又、一般式(V)で表されるアミン類は Chem. Pharm. Bull., 30(5), 1921-1924 (1982)、実験化学講座22 有機合成IV(アミノ酸、ペプチド)(1992)等に記載の方法により製造することができる。

【0051】

(2). 一般式(IV)→一般式(I-1)

本反応で使用できる不活性溶媒は(1)で使用できる不活性溶媒を例示することができる。

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、一般式(V)で表されるアミン類を過剰に使用することもできる。

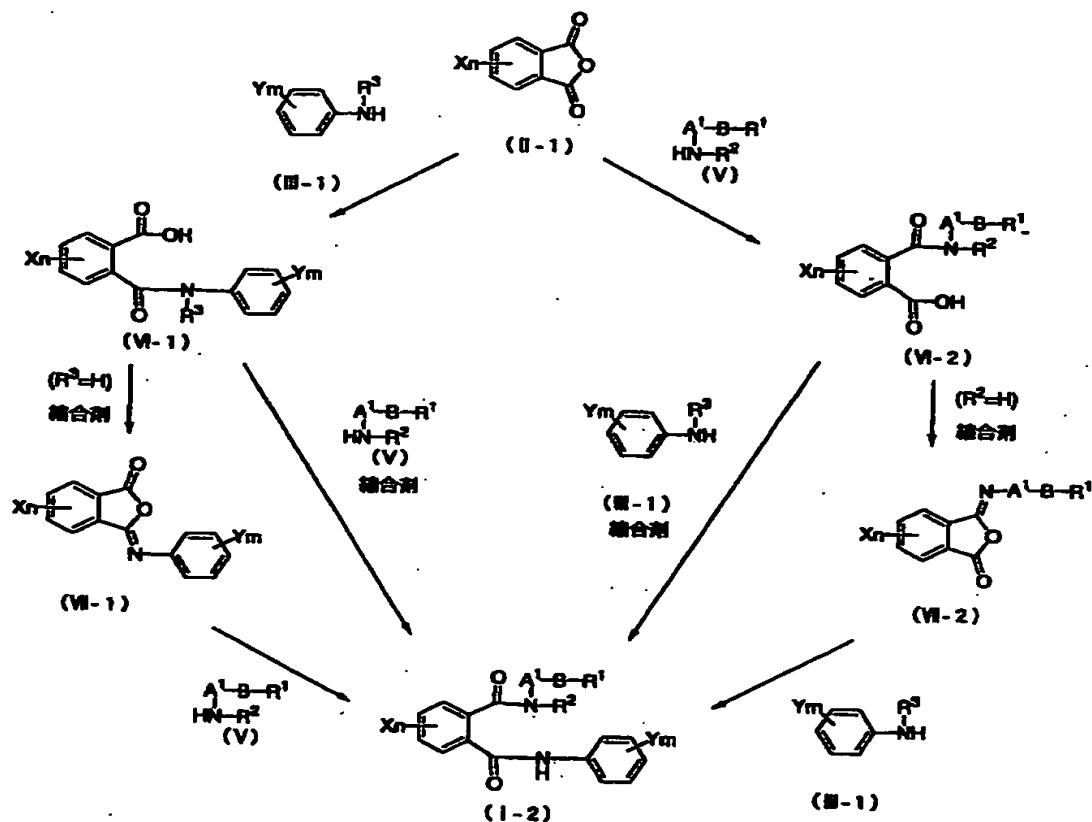
反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の還流温度下で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で適宜選択すれば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【0052】

製造方法2.

【化4】



(式中、R¹、R²、R³、A¹、B、X、Y、m及びnは前記に同じ。)

【0053】

一般式(II-1)で表されるフタル酸無水物誘導体と一般式(V)で表されるアミン類とを不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(VI-2)で表されるフタル酸アミド類とし、該フタル酸アミド類(VI-2)を単離し又は単離せずして、 R^2 が水素原子を示すフタル酸アミド類(VI-2)の場合、縮合剤の存在下に縮合反応を行い、一般式(VII-2)で表される化合物とし、該化合物(VII-2)を単離し又は単離せずして、不活性溶媒の存在下に一般式(III-1)で表されるアニリン類と反応させ、フタル酸アミド(VI-2)の R^2 が水素原子以外を示すフタル酸アミド類(VI-2)の場合、一般式(III-1)で表されるアニリン類と縮合剤の存在下に縮合させることにより、一般式(I-2)で表されるフタル酸ジアミド誘導体を製造することができる。

【0054】

又は一般式(II-1)で表されるフタル酸無水物誘導体と一般式(III-1)で表されるアニリン類とを不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(VI-1)で表されるフタル酸アミド類とし、該フタル酸アミド類(VI-1)を単離し又は単離せずして、 R^3 が水素原子を示すフタル酸アミド類(VI-1)の場合、縮合剤の存在下に縮合反応を行い、一般式(VII-1)で表される化合物とし、該化合物(VII-1)を単離し又は単離せずして、不活性溶媒の存在下に一般式(V)で表されるアミン類と反応させ、 R^3 が水素原子以外のフタル酸アミド類(VI-1)の場合、一般式(V)で表されるアミン類と縮合剤の存在下に縮合させることにより一般式(I-2)で表されるフタル酸ジアミド誘導体を製造することができる。

【0055】

(1) . 一般式(II-1)→一般式(VI-1)又は一般式(II-1)→一般式(VI-2)

本反応は製造方法1-(2)と同様にすることにより目的物を製造することができる。

(2) . 一般式(VII-1)又は一般式(VII-2)→一般式(I-2)

本反応は製造方法1-(2)と同様にすることにより目的物を製造することができる。

(3) . 一般式(VI-1)→一般式(VII-1)又は一般式(VI-2)→一般式(VII-2)

本反応は、J. Med. Chem. , 10, 982 (1967) に記載の方法に従って目的物を製造することができる。

【0056】

(4) . 一般式(VI-1)又は一般式(VI-2)→一般式(I-2)

一般式(VI-1)又は一般式(VI-2)で表されるフタル酸アミド誘導体と一般式(V)又は一般式(III-1)で表されるアミン類を縮合剤及び不活性溶媒の存在下に反応させて製造することができる。本反応は必要に応じて塩基の存在下に反応することもできる。

本反応で使用する不活性溶媒としては、例えばテトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン、塩化メチレン、クロロホルム等を例示することができる。

【0057】

本反応で使用する縮合剤としては、通常のアミド製造に使用されるものであれば良く、例えば向山試薬(2-クロロ-N-メチルピリジニウム アイオダイド)、DCC(1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド)、CDI(カルボニルジイミダゾール)、DEPC(シアノリン酸ジエチル)等を例示することができる、その使用量は、一般式(VI-1)又は一般式(VI-2)で表されるフタル酸アミド誘導体に対して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

本反応で使用する塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基類、炭酸カリウム等の無機塩基類を例示することができ、その使用量は一般式(VI-1)又は一般式(VI-2)で表されるフタル酸アミド誘導体に対して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

反応温度は0℃乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は、反応規模、反応温度等により一定しないが、数分乃至48時間の範囲である。

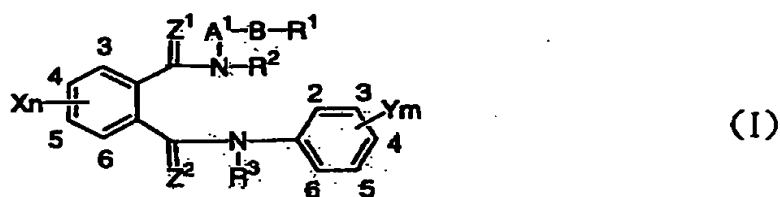
反応終了後、目的物を含む反応系から常法に従って単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【0058】

以下に一般式(I) で表されるフタル酸ジアミド誘導体の代表的な化合物を第1表及び第2表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。以下の表において、Me とはメチル基を、Et とはエチル基を、Pr とはプロピル基を、Bu とはブチル基を、Ph とはフェニル基を、Py r とはピリジル基を、c- は脂環式炭化水素基を示し、物性は融点 (°C) を示す。

一般式(I)

【化5】



【0059】

第1表 ($Z^1=Z^2=O$ 、 $R^3=H$)

No.	$-A^1-B-R^1$	R^2	X_n	Y_m	物性
1	CH_2CO_2Et	H	3-F	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	120
2	CH_2CO_2Et	H	3-Cl	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	103
3	CH_2CO_2Et	H	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	134
4	CH_2CO_2Et	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	120
5	$CH(Me)CO_2Et$	H	3-F	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	140
6	$CH(Me)CO_2Et$	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	145
7	$CH(Me)CH_2CO_2Et$	H	3-F	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	88
8	$CH_2CH_2CO_2Et$	H	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	112
9	$CH_2CH_2CO_2Et$	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	133
10	$CH_2CH_2CO_2Et$	H	6-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	164

【 0 0 6 0 】

第 1 表 (続 き)

No.	-A ¹ -B-R ¹	R ²	X _n	Y _m	物性
11	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	ペースト
12	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Me	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
13	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Pr-i	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
14	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Bu-t	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
15	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	4-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
16	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-CF ₃	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
17	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-OCF ₃	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
18	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
19	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-CH=C(Cl)CF ₃	
20	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-CH=CBr ₂	
21	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	4-CO ₂ CH(CF ₃) ₂	
22	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-C≡C- (2,4-Cl ₂ -Ph)	
23	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-C≡C-Bu-t	
24	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-CF ₃	2-F-4-CF ₂ CF ₃	
25	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
26	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-C(CH ₃)=NOMe	
27	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-C(CH ₃)=NO- CH ₂ -Ph	
28	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
29	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	3-OCF ₂ CF ₂ -4	
30	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Cl-3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
31	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	3-OCF ₂ O-4	

【 0 0 6 1 】

第 1 表 (続 き)

No.	-A ¹ -B-R ¹	R ²	X _n	Y _m	物性
32	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	3-OCHECF ₂ O-4	
33	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	3-OCF ₂ CHF0-4	
34	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	
35	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-5-F-4-CF(CF ₃) ₂	
36	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-(4-CF ₃ -Ph)	
37	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-(4-Cl-Ph)	
38	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-(4-Cl-PhO)	
39	CH(Me)CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-OCF ₃	
40	CH(Me)CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CF ₃	
41	CH(Me)CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-CF ₃	
42	CH(Me)CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-3-CF ₂ CF ₃	
43	CH(Me)CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-SCF ₃	
44	CH(Me)CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-SOCF ₃	
45	CH(Me)CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-SO ₂ CF ₃	
46	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-SCF ₂ CF ₃	
47	CH(Me)CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHFOCF ₃	
48	CH(Me)CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-(5-CF ₃ -2-Pyr-0)	
49	CH(Me)CO ₂ Et	H	3-Cl	2-Me-4-(3-Cl-5-CF ₃ -2-Pyr-0)	
50	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-NO ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
51	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3,4-Cl ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
52	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-SCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
53	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-SOCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

【0062】

第1表 (続き)

No.	-A ¹ -B-R ¹	R ²	Xn	Ym	物性
54	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-SO ₂ CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
55	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-Ph	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
56	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-OPh	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
57	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-(4-Cl-PhO)	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
58	CH(Me)CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-Cl	
59	CH(Me)CO ₂ Et	H	3-CONHPr-i	2-Me-4-Cl	
60	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-CH=CH-CH=CH-4	2-Me-4-Cl	
61	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
62	CH(Me)CH ₂ CO ₂ Et	Et	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
63	C(Me) ₂ C≡CCO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
64	C(Me) ₂ CH=CHCO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
65	CH(CH ₂ SMe)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
66	CH(CF ₃)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
67	CH(CH ₂ OMe)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
68	CH(Ph)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
69	CH(4-Cl-Ph)CH ₂ CO ₂ Et	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
70	CH(Me)CON(Me) ₂	H	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	122
71	CH(Me)CON(Me) ₂	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	156
72	CH(Me)CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	133
73	CH(Me)CH ₂ CONHMe	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	220
74	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	208
75	CH(Me)CH ₂ CONHPh	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	200
76	CH(Me)CH ₂ CON(Me) ₂	H	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	102

【 0 0 6 3 】

第 1 表 (続 き)

No.	-A ¹ -B-R ¹	R ²	Xn	Ym	物性
77	CH(Me)CH ₂ CON(Me) ₂	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	126
78	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	137
79	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	4-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	80 CH(M
	e)CH ₂ CONHEt H 3-CF ₃			2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
81	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-OCF ₃	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
82	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-I	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
83	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-I	2-Me-4-CH=C(Cl)CF ₃	84 CH(M
	e)CH ₂ CONHEt H 3-I			2-Me-4-CH=CBr ₂	
85	CH(Me)CON(Et) ₂	H	3-I	4-CO ₂ CH(CF ₃) ₂	
86	CH(Me)CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-C≡C-	
				(2,4-Cl ₂ -Ph)	
87	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-I	2-Me-4-C≡C-Bu-t	
88	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-CF ₃	2-F-4-CF ₂ CF ₃	
89	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-I	2-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	90 CH(Me)
	CH ₂ CON(Et) ₂ H 3-I			2-Me-4-C(CH ₃)=NOMe	
91	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-C(CH ₃)=NO-	
				CH ₂ -Ph	
92	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-I	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
93	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-I	3-OCF ₂ CF ₂ -4	
94	CH(Me)CON(Et) ₂	H	3-I	2-Cl-3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
95	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-I	3-OCF ₂ O-4	
96	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-I	3-OCHF ₂ O-4	
97	CH(Me)CON(Et) ₂	H	3-I	3-OCF ₂ CHFO-4	

【 0 0 6 4 】

第 1 表 (続 き)

No.	-A ¹ -B-R ¹	R ²	Xn	Ym	物性
98	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	
99	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-I	2-Me-5-F-4-CF(CF ₃) ₂	
100	CH(Me)CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-(4-CF ₃ -Ph)	
101	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-(4-Cl-Ph)	
102	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-I	2-Me-4-(4-Cl-PhO)	
103	CH(Me)CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-OCF ₃	
104	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CF ₃	
105	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-I	2-Me-4-CF ₃	
106	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-I	2-Me-3-CF ₂ CF ₃	
107	CH(Me)CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-SCF ₃	
108	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-SOCF ₃	
109	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-I	2-Me-4-SO ₂ CF ₃	
110	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-I	2-Me-4-SCF ₂ CF ₃	
111	CH(Me)CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHFOCF ₃	
112	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-(5-CF ₃ -2-Pyr-O)	
113	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-Cl	2-Me-4-(3-Cl-5-CF ₃ -2-Pyr-O)	
114	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-NO ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
115	CH(Me)CON(Et) ₂	H	3,4-Cl ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
116	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-SCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
117	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-SOCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
118	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-SO ₂ CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
119	CH(Me)CON(Et) ₂	H	3-Ph	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

【 0 0 6 5 】

第 1 表 (続 き)

No.	-A ¹ -B-R ¹	R ²	Xn	Ym	物性
120	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-OPh	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
121	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-(4-Cl-Ph)	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
122	CH(Me)CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-Cl	
123	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-CONHPr-i	2-Me-4-Cl	
124	CH(Me)CH ₂ CONHEt	H	3-CH=CH-CH=CH-4	2-Me-4-Cl	
125	CH(Me)CON(Et) ₂	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
126	CH(Me)CH ₂ CON(Et) ₂	Et	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
127	C(Me) ₂ C≡CCON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
128	C(Me) ₂ CH=CHCON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
129	CH(CH ₂ SMe)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
130	CH(CF ₃)CH ₂ CONHEt	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
131	CH(CH ₂ OMe)CH ₂ CONHEt	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
132	CH(Ph)CH ₂ CON(Et) ₂	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
133	CH(4-Cl-Ph)CH ₂ CONHEt	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
134	CH(Me)COMe	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	189
135	CH(Me)COPh	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	171
136	CH(Me)CH=NOMe	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	192
137	CH(Me)CH=NOMe	H	6-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	ペースト
138	CH(Me)CH=NOCH ₂ Ph	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	ペースト
139	C(Me) ₂ CH=NOMe	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	126
140	CH(Me)C(Me)=NOMe	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	107
141	CH ₂ C(Ph)=NOMe	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	106
142	CH(Me)CH=NOMe	H	4-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

【 0 0 6 6 】

第 1 表 (続 き)

No.	-A ¹ -B-R ¹	R ²	X _n	Y _m	物性
143	CH(Me)C(Me)=NOMe	H	3-CF ₃	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
144	CH(Me)CH=NOMe	H	3-OCF ₃	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
145	C(Me) ₂ CH=NOMe	H	3-I	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
146	CH(Me)CH=NOMe	H	3-I	2-Me-4-CH=C(Cl)CF ₃	
147	CH(Me)C(Me)=NOMe	H	3-I	2-Me-4-CH=Br ₂	
148	CH(Me)CH=NOMe	H	3-I	4-CO ₂ CH(CF ₃) ₂	
149	C(Me) ₂ CH=NOMe	H	3-I	2-Me-4-C≡C- (2,4-Cl ₂ -Ph)	
150	CH(Me)CH=NOMe	H	3-I	2-Me-4-C≡C-Bu-t	
151	CH ₂ C(Me)=NOMe	H	3-CF ₃	2-F-4-CF ₂ CF ₃	
152	CH(Me)CH=NOMe	H	3-I	2-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
153	C(Me) ₂ CH=NOMe	H	3-I	2-Me-4-C(CH ₃)=NOMe	
154	CH(Me)CH=NOMe	H	3-I	2-Me-4-C(CH ₃)=NO- CH ₂ -Ph	
155	CH(Me)C(Me)=NOMe	H	3-I	3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
156	CH(Me)CH=NOMe	H	3-I	3-OCF ₂ CF ₂ -4	
157	C(Me) ₂ CH=NOMe	H	3-I	2-Cl-3-OCF ₂ CF ₂ O-4	
158	CH(Me)C(Me)=NOMe	H	3-I	3-OCF ₂ O-4	
159	CH(Me)CH=NOMe	H	3-I	3-OCHF ₂ CF ₂ O-4	
160	C(Me) ₂ CH=NOMe	H	3-I	3-OCF ₂ CHFO-4	
161	CH(Me)CH=NOMe	H	3-I	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	162 CH
	(Me)C(Me)=NOMe	H	3-I	2-Me-5-F-4-CF(CF ₃) ₂	163 CH(Me)CH=NOM
e	H	3-I		2-Me-4-(4-CF ₃ -Ph)	

【0067】

第1表 (続き)

No.	$-A^1-B-R^1$	R^2	X_n	Y_m	物性
164	$C(Me)_2CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-(4-Cl-Ph)	
165	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-(4-Cl-PhO)	
166	$CH(Me)C(Me)=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-OCF ₃	
167	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CF ₃	
168	$C(Me)_2CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-CF ₃	
169	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-3-CF ₂ CF ₃	
170	$CH(Me)C(Me)=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-SCF ₃	
171	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-SOCF ₃	
172	$C(Me)_2CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-SO ₂ CF ₃	
173	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-SCF ₂ CF ₃	
174	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHFOCF ₃	
175	$C(Me)_2CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-(5-CF ₃ -2-Pyr-O)	
176	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-Cl	2-Me-4-(3-Cl-5-CF ₃ -2-Pyr-O)	
177	$C(Me)_2CH=NOMe$	H	3-NO ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
178	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3,4-Cl ₂	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
179	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-SCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
180	$C(Me)_2CH=NOMe$	H	3-SOCF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
181	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-SO ₂ CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
182	$C(Me)_2CH=NOMe$	H	3-Ph	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
183	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-OPh	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
184	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-(4-Cl-PhO)	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
185	$C(Me)_2CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-Cl	

【 0 0 6 8 】

第 1 表 (続 き)

No.	$-A^1-B-R^1$	R^2	X_n	Y_m	物性
186	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-CONHPr-i	2-Me-4-Cl	
187	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-CH=CH-CH=CH-4	2-Me-4-Cl	
188	$CH(Me)CH=NOMe$	Me	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
189	$C(Me)_2CH=NOMe$	Et	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
190	$CH(CH_2SMe)CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
191	$CH(CF_3)CH=NOEt$	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
192	$CH(CH_2OMe)CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
193	$CH(Ph)CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
194	$CH(Me)CH_2CH=NOMe$	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
195	$CH(Me)CH=NOCH_2-$ (4-t-Bu-Ph)	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
196	$CH(Me)CH=NOCH_2-$ (4-t-BuO ₂ C-Ph)	H	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

【0069】

第2表 ($Z^1=S$, $Z^2=O$, $R^3=H$)

No.	$-A^1-B-R^1$	R^2	X_n	Y_m	物性
197	$CH(Me)CH=NOMe$	H	3-Cl	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
198	$CH(Me)C(Me)=NOMe$	H	H	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
199	$CH(Me)CH_2CO_2Et$	H	3-Cl	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
200	$CH(Me)CON(Et)_2$	H	3-Cl	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
201	$CH(Me)CH_2CONHEt$	H	3-Cl	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

【0070】

以下に本発明の代表的な実施例を例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

【実施例】

実施例1.

(1-1). 3-ヨード-1-N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-フタルアミド酸の製造。

3-ヨードフタル酸無水物 3.5 g のアセトニトリル 30 ml 懸濁液に、氷冷下、4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルアニリン 3.5 g のアセトニトリル 3 ml 溶液を徐々に滴下し、滴下終了後、3時間室温で攪拌下に反応を行った。反応終了後、析出した結晶を濾取し、少量のアセトニトリルで洗浄することにより、目的物 4.0 g を得た。

物性: m. p. 174~181℃ 収率: 57%

【0071】

(1-2). 3-ヨード-N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)フタル酸イソイミドの製造。

3-ヨード-1-N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-フタルアミド酸 2.0 g のトルエン 10 ml 懸濁液に、トリフルオロ酢酸

無水物 1. 1 g を加え、室温で 30 分間攪拌下に反応を行った。反応終了後、溶媒を減圧下に留去して目的物の粗生成物 2. 0 g を得た。得られた目的物は精製することなく次の反応に使用した。

$^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS 、 δ 値(ppm)]

2.4(3H.s), 7.3(1H.d), 7.4(2H.m), 7.5(1H.t), 8.1(1H.d), 8.2(1H.d).

【0072】

(1-3). 3-ヨード-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-[1-メチル-2-(N,N-ジメチルカルバモイル)エチル]フタル酸ジアミド(化合物No. 77)の製造。

3-ヨード-N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)フタル酸イソイミド 1.0 g をアセトニトリル 10 ml に溶解し、該溶液に 3-アミノ-N,N-ジメチルブタン酸アミド・塩酸塩 0.35 g 及びトリエチルアミン 0.21 g を加えて、室温下に 10 時間攪拌した。反応終了後、反応混液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物 0.40 g を得た。

物性: m. p. 126℃ 収率: 32%

【0073】

製造例 2. 3-ヨード-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-[1-メチル-2-(メトキシイミノ)エチル]フタル酸ジアミド(化合物No. 136)の製造。

3-ヨード-N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)フタル酸イソイミド 0.9 g をアセトニトリル 10 ml に溶解し、該溶液に塩酸 1-メチル-2-(メトキシイミノ)エチルアミン 0.34 g 及びトリエチルアミン 0.25 g を加えて、室温下に 10 時間攪拌した。反応終了後、反応混液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物 0.36 g を得た。

物性: m. p. 192℃ 収率: 36%

【0074】

製造例 3.

(3-1). 3-ヨード-2-N-[1-メチル-2-(エトキシカルボニル)エチル]-フタルアミド酸の製造。

3-ヨードフタル酸無水物 2.7 g のアセトニトリル 30 ml 懸濁液に、氷冷下、3-アミノ酪酸エチル 1.4 g のアセトニトリル 3 ml 溶液を徐々に滴下し、滴下終了後、3 時間室温で攪拌下に反応を行った。反応終了後、析出した結晶を濾取し、少量のアセトニトリルで洗浄することにより、目的物 3.8 g を得た。

収率：97%

【0075】

(3-2). 6-ヨード-N-[1-メチル-2-(エトキシカルボニル)エチル]-フタル酸イソイミドの製造。

3-ヨード-2-N-[1-メチル-2-(エトキシカルボニル)エチル]-フタルアミド酸 1.0 g のトルエン 10 ml 懸濁液に、トリフルオロ酢酸無水物 1.1 g を加え、室温で 30 分間攪拌下に反応を行った。反応終了後、溶媒を減圧下に留去して目的物の粗生成物 0.9 g を得た。得られた目的物は精製することなく次の反応に使用した。

【0076】

(3-3). 3-ヨード-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-[1-メチル-2-(エトキシカルボニル)エチル]フタル酸ジアミド (化合物 No. 11) の製造。

6-ヨード-N-[1-メチル-2-(エトキシカルボニル)エチル]-フタル酸イソイミド 0.9 g をアセトニトリル 10 ml に溶解し、該溶液に 4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルアニリン 0.5 g 及びトリフルオロ酢酸 2 滴を加えて、室温下に 10 時間攪拌した。反応終了後、反応混液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物 0.50 g を得た。

物性： ペースト状

収率： 31%

$^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS 、 δ 値(ppm)]

1.1-1.4(5H.m), 2.4(3H.s), 2.5-2.6(2H.m), 4.1(2H.q), 4.4-4.5(1H.m),
6.8(1H.d), 7.2(1H.t), 7.4-7.5(2H.m), 7.8(1H.d), 7.9(1H.d),
8.3(1H.d), 8.5(1H.s).

【0077】

製造例 4. 3-ヨード-N¹-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)-N²-(3-オキソブタン-2-イル)フタル酸ジアミド(化合物No. 134)の製造。

3-ヨード-N-(4-ヘプタフルオロイソプロピル-2-メチルフェニル)フタル酸イソイミド 1.5 g をアセトニトリル 10 ml に溶解し、該溶液に 3-アミノブタノン・塩酸塩 0.35 g 及びトリエチルアミン 0.29 g を加えて、室温下に 10 時間攪拌した。反応終了後、反応混液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、目的物 0.70 g を得た。

物性： m. p. 189℃

収率： 41%

【0078】

本発明の一般式(I)で表されるフタル酸ジアミド誘導体又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適しており、例えばリンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes* sp.)、リンゴコシンクイ (*Grapholita inopinata*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、クワハマキ (*Olethreutes mori*)、チャノホソガ (*Caloptilia theviva*)、リンゴホソガ (*Caloptilia zachrysa*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*)、ナシホソガ (*Spulerrina astaurola*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*)、オオタバコガ類 (*Heliothis* sp.)、コドリリング (*Laspeyresia pomonella*)、コナガ (*Plutella*

la xylostella)、リンゴヒメシンクイ (Argyresthia conjugella)、モモシンクイガ (Carposina niponensis)、ニカメイガ (Chilo suppressalis)、コブノメイガ (Cnaphalocrocis medinalis)、

【0079】

チャマダラメイガ (Ephestia elutella)、クワノメイガ (Glyphodes pyloalis)、サンカメイガ (Scirpophaga incertulas)、イチモンジセセリ (Parnara guttata)、アワヨトウ (Pseudaletia separata)、イネヨトウ (Sesamia inferens)、ハスモンヨトウ (Spodoptera litura)、シロイチモンジヨトウ (Spodoptera exigua)、等の鱗翅目害虫、フタテンヨコバイ (Macrosteles fascifrons)、ツマグロヨコバイ (Nephotettix cincticeps)、トビイロウンカ (Nilaparvata lugens)、セジロウンカ (Sogatella furcifera)、ミカンキジラミ (Diaphorina citri)、ブドウコナジラミ (Aleurilobus taenabae)、タバココナジラミ (Bemisia tabaci)、オンシツコナジラミ (Trialeurodes vaporariorum)、ニセダイコンナブラムシ (Lipaphis erysimi)、モモアカアブラムシ (Myzus persicae)、ツノロウムシ (Ceroplastes ceriferus)、ミカンワタカイガラムシ (Pulvinaria aurantii)、

【0080】

ミカンマルカイガラムシ (Pseudaonidia duplex)、ナシマルカイガラムシ (Comstockaspis perniciosus)、ヤノネカイガラムシ (Unaspis yanonensis) 等の半翅目害虫、ネグサレセンチュウ (Pratylenchus sp.)、ヒメコガネ (Anomala rufocuprea)、マメコガネ (Popillia japonica)、タバコシバンムシ (Lasioderma serricorne)、ヒラタキクイムシ (Lyctus brunneus)、ニジュウヤホシテントウ (Epilachna vigintiotopunctata)、アズキゾウムシ (Callosobruchus chinensis)、ヤサイゾウムシ (Listroderes costirostris)、コクゾウムシ (Sitophilus zeamais)、ワタミゾウムシ (Anthonomus grandis grandis)、イネミズゾウムシ (Lissorhoptrus oryzophilus)、ウリハムシ (Aulacophora femoralis)、イネドロオイムシ (Oulema oryzae)、キスジノミハムシ (Phyllotreta striolata)、マツノキクイムシ (Tomococcus piniperda)、コロラドポテトビートル (Leptinotarsa decemlineata)、メキシカンビーンビートル (Epilachna

varivestis)、コーンルートワーム類 (*Diabrotica* sp.) 等の甲虫目害虫、ウリミバエ (*Dacus*(*Zeugodacus*) *cucurbitae*)、

【 0 0 8 1 】

ミカンコミバエ (*Dacus*(*Bactrocera*) *dorsalis*)、イネハモグリバエ (*Agromyza oryzae*)、タマネギバエ (*Delia antiqua*)、タネバエ (*Delia platura*)、ダイズサヤタマバエ (*Asphondylia* sp.)、イエバエ (*Musca domestica*)、アカイエカ (*Culex pipiens pipiens*) 等の双翅目害虫、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ネコブセンチュウ (*Meloidogyne* sp.)、ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*)、ニセネグサレセンチュウ (*Aphelenchus avenae*)、ハガレセンチュウ (*Aphelenchoides ritzemabosi*) 等のハリセンチュウ目害虫等に対して強い殺虫効果を有するものである。

【 0 0 8 2 】

本発明の一般式(I) で表されるフタル酸ジアミド誘導体又はその塩類を有効成分とする農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するものであるので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の水田水、茎葉又は土壌に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。

【 0 0 8 3 】

本発明の農園芸用薬剤は、農薬製剤上の常法に従い、使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

即ち、一般式(I) で表されるフタル酸ジアミド誘導体又はその塩類は、これらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させ、適宜の剤形、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、粒剤、粉剤、錠剤等に製剤して使用すれば良い。

本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、

鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、粉碎合成樹脂等の合成重合体、粘土類（例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等）、タルク類（例えばタルク、ピロフィライド等）、シリカ類（例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン〔含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。〕）、活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉碎物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、磷酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、硫酸、燐安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。

【0084】

液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうることとなるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類（例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等）、ケトン類（例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等）、エーテル類（例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等）、脂肪族炭化水素類（例えばケロシン、鉱油等）、芳香族炭化水素類（例えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等）、ハロゲン化炭化水素類（例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、塩素化ベンゼン等）、エステル類（例えば酢酸エチル、ジイソブチルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等）、アミド類（例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等）、ニトリル類（例えばアセトニトリル等）、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

【0085】

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用

し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び／又は湿潤の目的のために界面活性剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリアルスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エステル等の界面活性剤を例示することができる。

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び／又は結合の目的のために、次に例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

【0086】

固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、磷酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。

懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合磷酸塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えばシリコン油等の補助剤を使用することもできる。

有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、例えば粉剤或いは粒剤とする場合は0.01～50重量%、又乳剤或いは水和剤とする場合も同様0.01～50重量%が適当である。

【0087】

本発明の農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害防除に有効な量を当該害虫の発生が予測される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良い。

又、農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤は防除対象の植物の種子又は播種するための栽培担体（例えば、播種土壌、育苗マット、水等）等に適用して使用する

こともでき、稲育苗箱施用、種子粉衣等の施用方法、種子消毒法等の施用方法で
使用することができ、果樹、穀類、野菜等の畑作において発生する害虫に対して
は粉衣や浸漬等の種子処理、育苗用の栽培容器や植え穴等の育苗担体等に灌注、
表面散布後灌水等をして植物に吸収させて使用することもでき、水耕栽培におけ
る水耕液に処理することもできる。

本発明の農園芸用薬剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の
生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用
時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.1g~1
0kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

本発明の農園芸用薬剤は、更に防除対象病虫害、防除適期の拡大のため、或い
は薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用病虫害防除剤と混合して使用すること
も可能である。

【0088】

以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定さ
れるものではない。

尚、処方例中、部とあるのは重量部を示す。

製剤例1.

第1表又は第2表記載の化合物	50部
キシレン	40部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと	
アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	10部

以上を均一に混合溶解して乳剤とする。

製剤例2.

第1表又は第2表記載の化合物	3部
クレー粉末	82部
珪藻土粉末	15部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

【0089】

製剤例3.

第1表又は第2表記載の化合物	5部
ベントナイトとクレーの混合粉末	90部
リグニンスルホン酸カルシウム	5部

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。

製剤例4.

第1表又は第2表記載の化合物	20部
カオリンと合成高分散珪酸	75部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルとアル キルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	5部

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

【0090】

製剤例5.

第1表又は第2表記載の化合物	20部
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	3部
プロピレングリコール	5部
ジメチルポリシロキサン	0.25部
パラクロロメタキシレノール	0.10部
キサントガム	0.30部
水	71.35部

以上を均一に混合湿式粉碎し、水和剤又は水性懸濁剤とする。

【0091】

試験例1. コナガ (*Plutella xylostella*) に対する殺虫試験

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付いたハクサイ実生を第1表又は第2表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50 ppmに希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の恒温室内に静置した。薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、下記基準に従って判定を行った。1区10頭3連制

【0092】

[数 1]

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区孵化虫数} - \text{処理区孵化虫数}}{\text{無処理区孵化虫数}} \times 100$$

- 判定基準.
- A . . . 死虫率 100 %
 - B . . . 死虫率 99 % ~ 90 %
 - C . . . 死虫率 89 % ~ 80 %
 - D . . . 死虫率 79 % ~ 50 %

【0093】

試験例 2. ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) に対する殺虫試験

第 1 表又は第 2 表記載の化合物を有効成分とする薬剤を 50 ppm に希釈した薬液にキャベツ葉片 (品種: 四季穫) を約 30 秒間浸漬し、風乾後に直径 9 cm のプラスチックシャーレに入れ、ハスモンヨトウ 2 令幼虫を接種した後、蓋をして 25℃ の恒温室に静置した。接種 8 日後に生死虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、判定基準は試験例 1 に従って行った。1 区 10 頭 3 連制

【0094】

[数 2]

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区生存虫数} - \text{処理区生存虫数}}{\text{無処理区生存虫数}} \times 100$$

【0095】

試験例 3. チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes* sp.) に対する殺虫試験

第 1 表又は第 2 表記載の化合物を有効成分とする薬剤を 50 ppm に希釈した薬液にチャ葉を約 30 秒間浸漬し、風乾後に直径 9 cm のプラスチックシャーレに入れ、チャノコカクモンハマキ幼虫を接種した後、25℃、湿度 70% の恒温

室に静置した。接種 8 日後に生死虫数を調査し、試験例 1 の判定基準に従って判定を行った。1 区 10 頭 3 連制

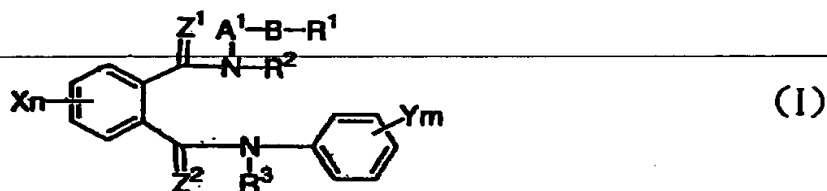
試験例 1、試験例 2 及び試験例 3 の結果、化合物 No 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、70、71、72、73、74、75、76、77、78、134、135、136、137、138、139、140 及び 141 の化合物はコナガ、ハスモンヨトウ及びチャノコカクモンハマキに対して B 以上の殺虫活性を示した。

【書類名】 要約書

【要約】

【解決手段】 式(I) :

【化1】



{式中、 A^1 は(置換) C_1-C_8 アルキレン、(置換) C_3-C_8 アルケニレン、(置換) C_3-C_8 アルキニレン等(これらの基は (C_3-C_6) シクロアルカン環又は (C_3-C_6) シクロアルケン環で置換又は中断されてもよい)、 B は $-CO-$ 又は $-C(=N-OR^4)-$ (式中、 R^4 はH、(ハロ) (C_1-C_6) アルキル基等)、 R^1 はH、(ハロ) (C_1-C_6) アルキル、(ハロ) (C_2-C_6) アルケニル、(ハロ) (C_3-C_6) シクロアルキル、(置換)フェニル、(置換)フェニルアミノ、(置換)複素環等、 R^2 、 R^3 はH、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 $-A^2-R^5$ (式中、 A^2 は $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-C(=NR^6)-$ (式中、 R^6 はH、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルコキシ、(置換)フェニル、(置換)フェニルアミノ、(置換)複素環等)、 X 、 Y はハロゲン、CN、NO、(ハロ) (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、(置換)フェニル、(置換)フェニルアミノ、(置換)複素環等、 $-A^5-R^{10}$ 等、 m は0~5、 n は0~4、 Z^1 、 Z^2 はO、S。} で表されるフタル酸ジアミド誘導体及び該化合物を有効成分とする農園芸用薬剤。

【効果】 式(I) のフタル酸ジアミド誘導体は農園芸用薬剤、特に殺虫剤として優れた防除効果を示す。

【選択図】 なし

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号

[000232623]

1. 変更年月日	1990年 8月 9日
[変更理由]	新規登録
住 所	東京都中央区日本橋1丁目2番5号
氏 名	日本農薬株式会社